(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro





(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 24. April 2003 (24.04.2003)

**PCT** 

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/032993 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 31/50, 31/54, 31/535, A61P 19/10, 35/00, 37/00, 3/10

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP02/10507

(22) Internationales Anmeldedatum:

19. September 2002 (19.09.2002)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:

101 50 517.5

12. Oktober 2001 (12.10.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): EGGENWEILER, Hans-Michael [DE/DE]; Erbacher Strasse 49, 64287 Darmstadt (DE). WOLF, Michael [DE/DE]; Nussbaumallee 59, 64297 Darmstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## Veröffentlicht:

mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: USE OF PHOSPHORODIESTERASE IV INHIBITORS

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON PHOSPHODIESTERASE IV - INHIBITOREN

(57) Abstract: The invention relates to the use of Phosphodiesterase IV inhibitors and/or the physiologically acceptable salts thereof in the production of a medicament for the treatment of osteoporosis, tumors, tumor metastases, atherosclerosis, rheumatoid arthritis, multiple sclerosis, diabetes mellitus, ulzerative colitis and AIDS.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von Phosphodiesterase IV - Inhibitoren und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose, Diabetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.



Į,

5

10

20

25

30

35

## Verwendung von Phosphodiesterase IV - Inhibitoren

Die Erfindung betrifft die Verwendung von

a) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 738 715 A2,

 $R^3$   $R^4$   $R^2$  N-N  $Q-R^5$ 

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

B<sup>3</sup> und B<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander OH, OR<sup>10</sup>

15 R³ und R⁴ jeweils unabhängig voneinander -OH, -OR¹0, -S-R¹0, -SO-R¹0, -SO<sub>2</sub>-R¹0, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHR<sup>10</sup> oder -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>,

R<sup>5</sup> einen unsubstituierten oder ein- oder zweifach durch R<sup>6</sup> und/oder R<sup>7</sup> substituierten Phenylrest,

und/oder R' substituierten Phenylrest,

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomon

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander -NH<sub>2</sub>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -NHR<sup>10</sup>,

-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -NO<sub>2</sub>, Hal, -CN, -OA, -COOH oder -COOA,

R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> jeweils unabhängig voneinander H, Acyl mit 1-8 C-

Atomen, das durch 1-5 F- und/oder CI-Atome substitu-

iert sein kann, -COOA, -SO-A, -SO<sub>2</sub>A,

-CONH<sub>2</sub>, -CONHA, -CONA<sub>2</sub>, -CO-COOH, -CO-COOA,

-CO-CONH<sub>2</sub>, -CO-CONHA oder -CO-CONA<sub>2</sub>,

Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder

Cl-Atome substituiert sein kann,

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7 C-

Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder

Alkenyl mit 2-8 C-Atomen

und

Α

35

Ì

Hal F, CI, Br oder I bedeuten,

b) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 723 962 B1,

$$R^{4} \longrightarrow R^{1} \longrightarrow R^{2}$$

$$N-N$$

$$Q-R^{5}$$

worin

R¹ und R² jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R³ und R⁴ jeweils unabhängig voneinander -OH, -OR¹0, -S-R¹0,
-SO-R¹0, -SO₂-R¹0, Hal, Methylendioxy, -NO₂, -NH₂,
-NHR¹0 oder -NR¹0R¹1,

einen unsubstituierten oder ein- oder zweifach durch R⁶ und/oder R² substituierten Phenylrest,

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander -NH<sub>2</sub>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -NHR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -NO<sub>2</sub>, Hal, -CN, -OA, -COOH oder -COOA,

-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -NO<sub>2</sub>, Hal, -CN, -OA, -COOH oder -COOA, jeweils unabhängig voneinander H, Acyl mit 1-8 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substituiert sein kann, -COOA, -SO-A, -SO<sub>2</sub>A, -CONH<sub>2</sub>, -CONHA, -CONA<sub>2</sub>, -CO-COOH, -CO-COOA, -CO-CONH<sub>2</sub>, -CO-CONHA oder -CO-CONA<sub>2</sub>,

A Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substituiert sein kann,

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder Alkenyl mit 2-8 C-Atomen und

Hal

F, Cl, Br oder I

bedeuten,

5 Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 763 534 A1, c)

worin

30

В einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 4 N-, Ound/oder S-Atomen, über N oder C gebunden, der un-20 substituiert oder ein-, zwei- oder dreifach durch Hal, A und/oder OA substituiert sein kann, und auch an einen Benzol- oder Pyridinring kondensiert sein kann, Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen, 25 Χ CH<sub>2</sub>, S oder O,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander -OH, OR5, -S-R5,

-SO-R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>5</sup>, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHR<sup>5</sup> oder -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>,

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder

Alkenyl mit 2-8 C-Atomen,

Alkyl mit 1 bis 10 C-Atomen, das durch 1 bis 5 F-Α 35 und/oder CI-Atome substituiert sein kann und

Hal F, Cl, Br oder I bedeuten,

d) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 539 806 B1,

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

15  $R^3$  H, OA oder O-C<sub>m</sub>H<sub>2m+1-n</sub>X<sub>n</sub>,

 $R^4$  -O-C<sub>m</sub>H<sub>2m+1-n</sub>X<sub>n</sub>,

X F oder CI,

A Alkyl mit 1-6 C-Atomen,

20 m 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 und

n 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12 oder 13

bedeuten,

e) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 618 201 A1,

$$R^3$$
 $R^1$ 
 $R^2$ 
 $S$ 
 $O$ 
 $N-N$ 
 $Q-R^5$ 

worin

30

35 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander OH, OA, SA, SOA, SO<sub>2</sub>A, Hal, Methylendioxy, Cycloalkyloxy mit 3-7 C-Atomen oder O- $C_mH_{2m+1-k}F_k$ ,

R<sup>5</sup> 5 -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> oder -N (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>

wobei eine CH2-Gruppe auch durch Sauerstoff ersetzt

sein kann,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A, 10

Q Alkylen mit 1-6 C-Atomen, Α Alkyl mit 1-6 C-Atomen,

Hal F, CI, Br oder I,

1, 2, 3, 4, 5 oder 6, m

3, 4, 5 oder 6, n

k 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12 oder 13

bedeuten,

Verbindungen der Formel I, offenbart in DE 196 04 388 A1, f) 20

worin

15

30 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander -OH, OA, -S-A,

> > -SO-A, -SO<sub>2</sub>-A, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHA oder -NAA',

jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1 bis 10 C-35 A und A'

Atomen, das durch 1 bis 5 F- und/oder Cl-Atome substi-

		tuiert sein kann, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen oder Me-
		thylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen,
	В	-Y-R⁵ oder -O-Y-R⁵,
_	Q	fehlt oder Alkylen mit 1-4 C-Atomen,
5	Υ .	fehlt oder Alkylen mit 1-10 C-Atomen,
	X	CH₂oder S,
	R <sup>5</sup>	NH <sub>2</sub> , NHA, NAA' oder einen unsubstituierten oder ein-
		fach durch A oder OH substituierten gesättigten 3-8-
10		gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom,
		worin zusätzlich weitere CH <sub>2</sub> -Gruppen durch NH, NA, S
		oder O ersetzt sein können,
•	Hal	F, Cl, Br oder I
15	bedeuten,	

und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose, Diabetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue Verwendungen der Verbindungen der Formeln I aufzufinden, insbesondere solche, die zur Herstellung von Arzneimitteln führen können.

Es wurde gefunden, daß die Verbindungen der Formeln I und ihre Salze bei guter Verträglichkeit sehr wertvolle pharmakologische Eigenschaften besitzen.

Insbesondere zeigen sie eine selektive Phosphodiesterase IV-Hemmung, die mit einer intrazellulären Erhöhung von cAMP verbunden ist (N. Sommer et al., Nature Medicine, 1, 244-248 (1995)).

30

20

Die PDE IV-Hemmung kann z.B. analog C.W. Davis in Biochim. biophys. Acta **797**, 354-362 (1984) nachgewiesen werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können zur Behandlung von asthmatischen Erkrankungen eingesetzt werden. Die antiasthmatische Wirkung der PDE IV-Hemmer ist z.B. von T.J. Torphy et al. in Thorax, 46,
512-523 (1991) beschrieben und kann z. B. nach der Methode von T. Olsson, Acta allergologica 26, 438-447 (1971), bestimmt werden.

10

Da cAMP knochenabbauende Zellen hemmt und knochenaufbauende Zellen stimuliert (S. Kasugai et al., M681 und K. Miyamoto, M 682, in Abstract der American Society for Bone and Mineral Research 18<sup>th</sup> annual meeting, 1996), können die erfindungsgemäßen Verbindungen zur Behandlung von Osteoporose eingesetzt werden.

15

20

Die Verbindungen zeigen außerdem eine hemmende Wirkung auf die Bildung von TNF (Tumor Nekrose Faktor) und eignen sich daher zur Behandlung von allergischen und entzündlichen Krankheiten, Autoimmunkrankheiten und Transplantatabstoßungsreaktionen.

Sie können zur Behandlung von Gedächtnisstörungen, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose,

25

Morbus Crohn, atopische Dermatitis, Diabetes mellitus, Ulzerative Kolitis und AIDS eingesetzt werden.

30

Die Wirkung von PDE IV-Hemmern bei der Behandlung von Asthma, entzündlichen Erkrankungen, Diabetes mellitus, atopischer Dermatitis, Psoriasis, AIDS, Tumorwachstum oder Tumormetastasen ist z.B. in der EP 779 291 beschrieben.

35

Die antiinflammatorische Wirkung der erfindungsgemäßen Substanzen und ihre Wirksamkeit zur Behandlung von z.B. Autoimmunerkrankungen,

25

30

35

Multiplesklerose oder rheumatoider Arthritis kann analog den Methoden von N. Sommer et al., Nature Medicine, 1, 244-248 (1995) oder L. Sekut et al., Clin. Exp. Immunol., 100, 126-132 (1995) bestimmt werden.

Die Wirkung von PDE IV-Hemmern bei der Tumorbehandlung ist z.B. in der WO 95 35 281, WO 95 17 399 oder WO 96 00 215 beschrieben.

Überraschenderweise wurde gefunden, daß die Verbindungen der Formeln I zur Behandlung von Krebs geeignet sind.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Verbindungen der Formeln I sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und/oder Solvate zur Herstellung eines Arzneimittels zur Inhibierung des Wachstums neoplastischer Zellen.

Unter neoplastischen Zellen werden Krebszellen verstanden.

Gegenstand der Erfindung ist insbesondere die Verwendung der Verbindungen der Formeln I sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und/oder Solvate zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung und/oder Prophylaxe von Krebserkrankungen.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Verbindungen der Formeln I sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und/oder Solvate zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung neoplastischer Schädigungen.

Gegenstand der Erfindung ist weiterhin die Verwendung der Verbindungen der Formeln I sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und/oder Solvate zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung präcancerogener Schädigungen.

25

30

35

Unter präcancerogenen Schädigungen versteht man z.B. gutartige Wucherungen im Darm, die zu Darmkrebs führen können.

Unter präcancerogenen Schädigungen werden insbesondere die in US 5,948,911 in Spalte 4, Zeilen 49-60 genannten Läsionen verstanden.

Unregelmäßigkeiten der Apoptose (Zelltod) spielen eine Rolle bei der Bildung präcancerogener Schädigungen.

Auch ist bekannt, daß die Regulierung von Apoptose bei Krankheiten eine wichtige Rolle spielt, die im Zusammenhang mit einem abnormalen Zellwachstum stehen, wie z.B. gutartige Prostatahyperplasie, neurodegenerative Erkrankungen, wie z.B. Parkinson, Autoimmunkrankheiten einschließlich Multiple Sklerose und rheumatoide Arthrithis oder Infektionskrankheiten wie AIDS.

Die Verbindungen der Formeln I, modulieren Apoptose und finden Verwendung bei der Behandlung oder Prophylaxe von Krebserkrankungen.

Gegenstand der Erfindung ist somit die Verwendung der Verbindungen der Formeln I sowie deren physiologisch unbedenklichen Salze und/oder Solvate zur Herstellung eines Arzneimittels zur Regulierung von Apoptose in menschlichen Zellen.

Die Verbindungen der Formeln I können als Arzneimittelwirkstoffe in der Human- und Veterinärmedizin eingesetzt werden. Ferner können sie als Zwischenprodukte zur Herstellung weiterer Arzneimittelwirkstoffe eingesetzt werden.

Die Verbindungen der Formeln I können ein chirales Zentrum aufweisen und können daher in mehreren stereoisomeren Formen auftreten. Alle diese Formen (z. B. R- und S-Formen) und deren Gemische (z. B. die R,S-Formen) sind in den Formeln I eingeschlossen.

WO 03/032993

5

10

15

20

35

Diese Verbindungen der Formeln I können als Arzneimittel in der Humanoder Veterinärmedizin verwendet werden. Als Trägerstoffe kommen organische oder anorganische Substanzen in Frage, die sich für die enterale (z.B. orale), parenterale oder topische Applikation eignen und mit den neuen Verbindungen nicht reagieren, beispielsweise Wasser, pflanzliche Öle, Benzylalkohole, Alkylenglykole, Polyethylenglykole, Glycerintriacetat. Gelatine, Kohlehydrate wie Lactose oder Stärke, Magnesiumstearat, Talk. Vaseline. Zur oralen Anwendung dienen insbesondere Tabletten, Pillen, Dragees, Kapseln, Pulver, Granulate, Sirupe, Säfte oder Tropfen, zur rektalen Anwendung Suppositorien, zur parenteralen Anwendung Lösungen. vorzugsweise ölige oder wässrige Lösungen, ferner Suspensionen, Emulsionen oder Implantate, für die topische Anwendung Salben, Cremes oder Puder. Die neuen Verbindungen können auch lyophilisiert und die erhaltenen Lyophilisate z.B. zur Herstellung von Injektionspräparaten verwendet werden. Die angegebenen Zubereitungen können sterilisiert sein und/oder Hilfsstoffe wie Gleit-, Konservierungs-, Stabilisierungs- und/oder Netzmittel, Emulgatoren, Salze zur Beeinflussung des osmotischen Druckes, Puffersubstanzen, Farb-, Geschmacks- und /oder ein oder mehrere weitere Wirkstoffe enthalten, z.B. ein oder mehrere Vitamine.

Die Verbindungen der Formeln I und ihre physiologisch unbedenklichen Salze können bei der Bekämpfung von Krankheiten, bei denen eine Erhöhung des cAMP(cyclo-Adenosin-monophosphat)-Spiegels zu Entzündungshemmung oder -verhinderung und Muskelentspannung führt, eingesetzt werden. Besondere Verwendung können die erfindungsgemäßen Verbindungen bei der Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Asthma, chronischer Bronchitis, atopischer Dermatitis, Psoriasis und anderer Hautkrankheiten und Autoimmunerkrankungen finden.

Dabei werden die erfindungsgemäßen Substanzen in der Regel vorzugsweise in Dosierungen zwischen etwa 1 und 500 mg, insbesondere zwi-

10

15

25

30

35

schen 5 und 100 mg pro Dosierungseinheit verabreicht. Die tägliche Dosierung liegt vorzugsweise zwischen etwa 0,02 und 10 mg/kg Körpergewicht. Die spezielle Dosis für jeden Patienten hängt jedoch von den verschiedensten Faktoren ab, beispielsweise von der Wirksamkeit der eingesetzten speziellen Verbindung, vom Alter, Körpergewicht, allgemeinen Gesundheitszustand, Geschlecht, von der Kost, vom Verabreichungszeitpunkt und -weg, von der Ausscheidungsgeschwindigkeit, Arzneistoffkombination und Schwere der jeweiligen Erkrankung, welcher die Therapie gilt. Die orale Applikation ist bevorzugt.

Verbindungen der Formeln I können ein oder mehrere Asymmetriezentren enthalten. In diesem Fall liegen sie gewöhnlich in racemischer Form vor. Erhaltene Racemate können nach an sich bekannten Methoden mechanisch oder chemisch in ihre Enantiomeren getrennt werden. Vorzugsweise werden aus dem racemischen Gemisch durch Umsetzung mit einem optisch-aktiven Trennmittel Diastereomere gebildet.

20 Gegenstand der Erfindung ist insbesondere die Verwendung von

- a) Verbindungen, offenbart in EP 0 738 715 A2, ausgewählt aus der Gruppe
- 2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 126°;
- 2-(3-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 122°;
- 2-(2-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2,3-Dinitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2,4-Dinitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2-Methoxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

15

25

- 2-(4-Methoxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2-Chlorbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2,6-Dichlorbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Cyanbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Carboxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(2-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(2,3-Dinitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-20 hydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2,4-Dinitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2-Methoxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-Methoxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2-Chlorbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(2,6-Dichlorbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-Cyanbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Carboxybenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;

pyridazin-3-on;

	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
5	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
10	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
15	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
20	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
20	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(4-methylsulfonylyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra
	hydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-
25	hydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
30	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on, F. 184°;
	2-(3-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
	pyridazin-3-on, F. 140°;
	2-(2-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
	pyridazin-2 op:

2-(2,3-Diaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-

hydro-pyridazin-3-on;

	2-(2,4-Diaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
	pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
_	tetrahydro-pyridazin-3-on;
5	2-(3-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on, F. 49°;
	2-(2-Aminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
10	2-(2,3-Diaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-
	hydro-pyridazin-3-on;
	2-(2,4-Diaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-
	hydro-pyridazin-3-on;
15	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
20	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
20	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
25	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
30	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on:

2-(4-Aminobenzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-

	2-(4-Aminobenzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-
	hydro-pyridazin-3-on;
5	2-(4-Aminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(3-Aminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on, F. 109°;
	2-(4-Aminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
	pyridazin-3-on;
10	2-(4-Aminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetra-
	hydro-pyridazin-3-on;
	2-(3-Aminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
	pyridazin-3-on, F. 112°;
15	2-(4-Carboxybenzyl)-6-(3,4-dihydroxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro
	pyridazin-3-on, F. 148°;
20	2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-
20	pyridazin-3-on, F. 183°;
	2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on, F. 210°;
	2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
25	tetrahydropyridazin-3-on, F. 138°;
	2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
30	tetrahydropyridazin-3-on, F. 176°;
	2-(4-tertButylcarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 155°;
	2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-

tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on, F. 147°; 5 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 10 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-20 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 133°; 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-25 tetrahydropyridazin-3-on, F. 81°; 2-(4-tert.-Butylcarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2.3.4.5tetrahydropyridazin-3-on, F. 117°; 30 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 144°;

2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-

	2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-
-	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F.154°;
5	2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
10	2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
15	2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5
	tetrahydropyridazin-3-on;
20	2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
20	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
25	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-lsobutyrylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
30	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
35	2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

WO 03/032993 PCT/EP02/10507

2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

5

- 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

10

- 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

15

- 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 162°;

20

- 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 69°;
- 2-(4-tert.-Butylcarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

30

25

- 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

35

2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

- 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 73°: 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 5 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 10 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Acetamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-15 tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Trifluoracetamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methylsulfonamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-20 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Propionylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Butyrylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-25 tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Isobutyrylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 30 2-(4-Pivalylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Cyclopentylcarbamoylphenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl- 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on:
- 2-(4-Ethoxycarbonylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Methoxalylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ureidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on: 5 2-(4-Pentanoylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Hexanoylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 10 2-(4-Pentafluorpropionylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Acetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-15 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 142°: 2-(3-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Propionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-20 tetrahydropyridazin-3-on, F. 126°; 2-(3-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-25 tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Pivalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 30 2-(3-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-.2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 54°; 35 2-(3-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-

2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

10

15

20

25

30

- 2-(3-Ureidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on: 2-(3-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on; 2-(3-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

- 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 5 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 10 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-15 ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-20 ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-25 ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 30 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-
- 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on:

2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-difluormethoxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 5 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 10 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-15 ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-20 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-25 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 30 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on: 35

2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-

ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on:

15

20

25

- 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on.
- 2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 5 2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 10 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxy-15 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxy-20 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-25 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 30 2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-. difluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on; 35

2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-

ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on:

	2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)
	5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
5	2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-
	phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
10	2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-
	phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
15	2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-
	phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
 	2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-
20	phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-
	5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-
25	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-
	5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
30	2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-methoxy-4-
	trifluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
35	tetrahydropyridazin-3-on, F. 170°;
	2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-

tetrahydropyridazin-3-on;

	2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-
5	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
10	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
15	2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 128°;
20	2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
20	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
25	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-
30	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Acetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
35	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-

phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;

	2-(4-Propionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
5	2-(4-tertButylcarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy
	phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
10	2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-
	phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
15	2-(4-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-
	phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-
	phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
20	2-(4-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)
20	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Ureidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
25	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
30	2-(4-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-
	methoxy-phenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Acetamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Trifluoracetamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
35	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(4-Methylsulfonamidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-

tetrahydropyridazin-3-on;

- 2-(4-Propionylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on:
- 2-(4-Butyrylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;

15

20

25

30

- 2-(4-Isobutyrylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Methoxycarbonylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 10 2-(4-Pivalylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(4-Cyclopentylcarbamoylphenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on:
  - 2-(4-Ethoxycarbonylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Methoxalylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Ureidophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Pentanoylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Hexanoylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(4-Pentafluorpropionylaminophenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
    - 2-(3-Acetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 105°;
    - 2-(3-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on, F. 136°;
    - 2-(3-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on, F. 177°;
  - 2-(3-Propionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on, F. 152°:

	2-(3-tertButylcarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
~	tetrahydropyridazin-3-on;
5	2-(3-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
10	2-(3-Pivalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
15	2-(3-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on, F. 179°;
	2-(3-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
20	2-(3-Ureidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
20	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
25	tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Acetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl
30	2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 70°;
	2-(3-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-
35	phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
	2-(3-Propionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-
	ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 113°;

15

25

- 2-(3-tert.-Butylcarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(3-Butyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(3-Isobutyrylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(3-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(3-Pivalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Cyclopentylcarbamoylbenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 153°;
  - 2-(3-Methoxalylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(3-Ureidobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-20 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Pentanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Hexanoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(3-Pentafluorpropionylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
  - 2-(4-Nitrobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 126°;
  - 2-(4-Nitrophenyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- b) Verbindungen, offenbart in EP 0 763 534, ausgewählt aus der Gruppe

2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on: 10 2-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-15 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylaino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-20 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-25 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 30 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-

2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

15

20

25

- 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on
    - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on
    - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 35 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

15

20

25

- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 35 3-(2-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

10

15

20

25

30

35

- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(3-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-Nicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 10 2-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluor-15 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-20 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-25 5- ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

	2-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-
5	methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-
	methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-
10	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro
	1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro
	1,3,4-thiadiazin-2-on;
15	3-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro
	1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-
	dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
20	3-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-
20	dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-
	dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-
25	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-
30	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
35	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
	3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-

ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

15

25

- 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
    - 3-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-20 3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:
  - 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(3-lsonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(2-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 35 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxypheny
c	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
5	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-
-	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
10	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl
	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-
	ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
15	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-
	ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-
	ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
20	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-
20	3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6
	dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-
25	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(3-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-
	methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-
30	dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Isonicotinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-
	3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
25	tetrahydro-pyridazin-3-on;
35	2-(3-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
	tetrahydro-pyridazin-3-on:

2-(2-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(3-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-15 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-20 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-25 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

- 2-(3-Picolinoylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

10

15

20

25

30

- 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(2-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(2-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 5 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3.6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-15 1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-20 1.3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-25 1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 30 3-(2-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 35

3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-

6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6
5	ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-
	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-
	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-
	ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-
	3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
15	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-
	3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-
	3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-
	dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
20	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-
	dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(3-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-
25	6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro
30	1,3,4-oxadiazin-2-on;
	3-(4-Picolinoylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-
	dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
	2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
35	2-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
	2-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
	2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

WO 03/032993 PCT/EP02/10507

2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-15 methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-Fluormethoxy-4-methoxy-20 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-25 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 30 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-

phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on:

2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1.3.4-thiadiazin-2-on: 10 3-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-20 methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 35 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-

6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

15

20

25

30

- 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:
- 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-10 6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 3-(3-(Furan-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-25 3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Furan-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 35 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 10 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-15 methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-20 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-25 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-

2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 10 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-20 methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 35 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-

methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

10

15

20

25

30

35

- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-
- ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

15

20

25

30

- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
    - 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Pyrrol-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrrol-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-15 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxy-20 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-25 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-

dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 186°: 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-25 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35

3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-

6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-20 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-25 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 35 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-

methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-Methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-15 methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Thiophen-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-20 dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Thiophen-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-25 tetrahydro-pyridazin-3-on, F. 197°; 2-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3.4-dimethoxyphenyl)-2.3.4.5tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-

2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-5-15 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxy-20 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-25 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-

dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 202°;

10

15

20

25

30

- 3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:
- 3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

WO 03/032993 PCT/EP02/10507

- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

5

10

15

20

25

- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(2-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 35 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

15

20

25

30

- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-Methoxy-4-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(3-Pyrazincarbonylamino-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-Pyrazincarbonylamino-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4difluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxv-4fluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-10 on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4ethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 15 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 20 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(4methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 25 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-30 dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxy-35 phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3.4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3.6-dihydro-1,3.4-thiadiazin-2-on: 5 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3.4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-15 difluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-20 4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-25 4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxy-15 phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-20 dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-25 trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4difluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3.6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 35 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

غي ني

3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-15 4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(6-Chlor-pyridazin-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-20 dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-25 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxy-15 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-20 5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-25 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

3-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3.4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-

methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3.6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-20 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-25 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 35

3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-

phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 3.6-dihydro-1.3.4-oxadiazin-2-on: 3-(4-(Imidazol-4-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-20 dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-25 dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4trifluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4difluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4fluor-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-10 fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4ethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 15 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 20 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 25 2-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(2.4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-30 dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-35 dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

3-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(2.4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4difluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-15 fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2.4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluor-20 methoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-25 ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3.6-dihydro-1.3.4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 5 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 10 3-(3-(Imidazol-4-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-15 dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-20 dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-25 difluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 35 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4methylenoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-15 dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(2,4-Dimethyl-thiazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-20 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on, F. 217°; 2-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-25 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluor-

methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

- 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxy-15 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-20 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-25 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 30 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 196°:
  - 3-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

35

3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-

3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 5 3-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 5 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-25 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 35 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-

phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on:

3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 5 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(3-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-20 2.3.4.5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-25 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluor-

methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

15

20

25

30

- 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-20 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-15 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-25 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 35 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-

phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Oxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Oxazol-5-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-20 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-25 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35

2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4-

methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 10 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-15 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-20 methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxy-25 phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35

3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-

ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on: 5 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-20 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-25 6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxy-

phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

10

15

20

25

30

- 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-
- 3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluor-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 5 3-(3-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(4-(Pyrimidin-2-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on: 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-15 2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-20 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-25 ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 30 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 35

2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-trifluormethoxy-4-

methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;

15

20

25

30

- 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-fluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxy-
- 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-hydroxy-4-methoxy-phenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylsulfonylphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(4-methylenoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 2-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxy-15 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxy-20 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-25 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-

dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 3-(2-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-difluor-15 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-difluormethoxy-4-20 methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-trifluormethoxy-4methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-fluormethoxy-4-methoxy-25 phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 30 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-hydroxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylsulfonylphenyl)-6-

3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(4-methylenoxyphenyl)-6-

ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;

ethyl-3.6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on:

- 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(3-(Pyrazol-3-carbonylamino)-benzyl)-5-(3-cyclopentyloxy-4methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 5 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 3-(4-(Pyrazol-3-carbonylamino)-phenethyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 10 2-(3-Nicotinoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydropyridazin-3-on, F. 204°; 2-(4-Isonicotinoylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, Hydrochlorid F. 252°; 2-(4-Pyrazincarbonylaminobenzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-15 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 202°; 2-(4-(Isoxazol-5-carbonylamino)-benzyl)-6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 192°; 2-(4-Nicotinoylaminobenzyl)-6-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-20 2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, F. 205° 2-(4-Nicotinoylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on, Hydrochlorid F. 212°; d)
- 25 Verbindungen, offenbart in EP 0 539 806 B1, ausgewählt aus der Gruppe
  - 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on, F. 97°;
- 5-(3-Methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-30 thiadiazin-2-on;
  - 5-(3-Methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-methyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on:
- 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-methyl-3,6-dihydro-1,3,4-35 thiadiazin-2-on:

PCT/EP02/10507 WO 03/032993

- 5-[3-Methoxy-4-(1,1,2,2-tetrafluorethoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 5-(3-Methoxy-4-chlormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;
- 5-(3-Methoxy-4-chlormethoxyphenyl)-6-methyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;

- 5-(3-Methoxy-4-pentachlorethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;
- 10 5-(3-Methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-propyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;
  - 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-propyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;
- 5-[3-Methoxy-4-(1,1,2,-trifluorethoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-15 1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 5-[3-Methoxy-4-(1,1,2,-trifluorethoxy)-phenyl]-6-methyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 5-(3-Methoxy-4-diffuormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-20 on, F. 120°;
  - 5-(3-Methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2on;
    - 5-(4-Trifluormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 25 5-[3-Methoxy-4-(1,1,2,2-tetrafluorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;
  - 5-(3-Methoxy-4-chlormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2on;
- 5-(3-Methoxy-4-trichlormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-30 on;
  - 5-(3-Methoxy-4-pentachlorethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 5-(4-Difluormethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 35 5-[3-Methoxy-4-(1,1,2,2,3-pentafluorpropoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

on;

5-[Bis-3,4-(difluormethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5-[Bis-3,4-(dichlormethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 5-[Bis-3,4-(1,2-difluorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-

5

5-[3-Ethoxy-4-(1,1,2,2,-tetrafluorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

5-[3-Methoxy-4-(1,2,2,-trichlorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

10

5-[4-(2,2,2-Trifluorethoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 102°;

5-[3-Methoxy-4-(2,2,2-trifluorethoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 123-125°;

15

5-[3-Methoxy-4-(2,2,2-trifluorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 120°;

5-[3-(2,2,2-Trifluorethoxy)-4-methoxy-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 120-121°;

5-(3-Difluormethoxy-4-methoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on, F. 105°;

20

e) Verbindungen, offenbart in EP 0 618 201 A1, ausgewählt aus der Gruppe

25

3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on, F. 175°;

3-Dimethylaminopropyl-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;

30

3-Dimethylaminopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;

3-Dimethylaminopropyl-5-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;

3-Dimethylaminopropyl-5-(4-methoxy-3-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on:

20

25

30

- 3-Dimethylaminopropyl-5-[4-methoxy-3-(2,2,2-trifluorethoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
- 3-Dimethylaminopropyl-5-(4-methoxy-3-fluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
- 3-Dimethylaminopropyl-5-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
- 3-Dimethylaminopropyl-5-(4-methoxy-3-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
- 3-Dimethylaminopropyl-5-(3-methoxy-4-hydroxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxy-phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
- 2-Dimethylaminoethyl-5-(3,4-dimethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(3-methoxy-4-fluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(4-methoxy-3-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(4-methoxy-3-fluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(3-methoxy-4-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(4-methoxy-3-ethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 2-Dimethylaminoethyl-5-(4-methoxy-3-hydroxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 3-Morpholinopropyl-5-[3-methoxy-4-(1,1,2,2,3-pentafluorpropoxy)-phenyl]-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;

3-Dimethylaminopropyl-5-[3,4-bis-(difluormethoxy)-phenyl]-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Dimethylaminopropyl-5-[3-methoxy-4-(1,1,2-trifluorethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 5 3-Dimethylaminopropyl-5-[3,4-bis-(chlormethoxy)-phenyl]-3,6-dihydro-1.3.4-thiadiazinon-2-on: 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 10 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Piperidinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-15 1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Piperidinopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazinon-2-on; 3-Pyrrolidinopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-20 1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Piperidinopropyl-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-25 1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Pyrrolidinopropyl-5-(3-methoxy-4-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-(4-methoxy-3-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 30 3-Piperidinopropyl-5-(4-methoxy-3-ethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 35 3-Piperidinopropyl-5-(4-methoxy-3-difluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-

dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;

3-Piperidinopropyl-5-[3-(2,2,2-trifluorethoxy)-4-methoxyphenyl]-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-[3-(2,2,2-trifluorethoxy)-4-methoxyphenyl]-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 2-Morpholinoethyl-5-(3-methoxy-4-fluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 2-Morpholinoethyl-5-(3-methoxy-4-trifluormethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 10 f) Verbindungen, offenbart in DE 196 04 388 A1, ausgewählt aus der Gruppe N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester; 15 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester, 20 Hydrochlorid, F. 218°; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-25 3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methylethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester, F. 183°; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-30 3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(4-hydroxy-1-piperidyl)-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-35 3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; 5 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester: 10 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-15 3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester, Hydrochlorid, F. 161°; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester; 20 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester; 25 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methylethylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; 30 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; 35 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-

3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester: 5 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; 10 N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; 15 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-20 ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester; 25 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methylethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester, F. 30 153;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-vlmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; 5 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; 10 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-15 thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-20 ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)ethylester; 25 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-30 methyl-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-

thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

10

15

20

25

30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-

1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,Ndiisopropylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

10

15

20

25

30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester:

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-6-ethyl-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

5

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

15

10

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

20

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

25

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

35

10

15

20

25

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester.

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

30

10

15

20

25

30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-10 thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; 15 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-20 1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropyl-25 amino)-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-

1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-

35

ester;

10

15

20

25

.30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thia-diazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-morpholino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

5

10

15

20

25

30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methyl-piperazino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-.. thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methyl-piperazino)-acetamid;

N-[3-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid;

5

10

15

20

25

30

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-y/methyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;
N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

5

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

10

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

15

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

20

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

25

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

30

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

35

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid; 5 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid; 10 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-15 thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-20 thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäure-amid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-25 thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid; 30 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid; 35 N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid;

	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid;
5	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid;
10	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-propoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid.
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
15	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
20	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
25	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
30	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-isopropoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-
	thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-
	1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäure-amid;
	N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-
35	1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäure-
	amid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-5 1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäure-amid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-10 1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid: N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäure-amid; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-15 1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2vlmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-20 ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-25 ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methylethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-30 ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(4-hydroxy-1-piperidyl)-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-35 2- ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

10

15

20

25

30

35

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester.

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N;N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester: N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; 5 N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyll-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; 10 N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-15 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester. N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-20 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-25 ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-30 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-

pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-

35

methyl-ethylester;

10

15

20

25

30

35

ethylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)ethylester; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

PCT/EP02/10507

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

5

10

15

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

20

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester;

25

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethyl-amino)-ethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyll-carbaminsäure-2-(N,N-

tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

10

15

20

25

30

35

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholinoethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholinoethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidinoethylester;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-hexylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1-methyl-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester;

10

5

15

20

25

30

WO 03/032993 PCT/EP02/10507

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; 5 N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-10 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)ethylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)ethylester; 15 N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)hexylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-20 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1methyl-ethylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; 25 N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenylj-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-30 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-

pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; 5 N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-propylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-10 propylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diethylamino)ethylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-15 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-diisopropylamino)ethylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-6-(N,N-dimethylamino)-20 hexylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(N,N-dimethylamino)-1methyl-ethylester; 25 N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-(1-methyl-4-piperidyl)-ester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-morpholino-ethylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-30 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-morpholino-propylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-thiomorpholino-ethylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-

pyridazin-2-v/methyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-thiomorpholino-propylester;

N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-piperazino-ethylester: N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-piperazino-propylester; 5 N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-pyrrolidino-ethylester; N-[4-(6-(3-Fluormethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-pyrrolidino-10 propylester. N-[4-(6-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid, F. 150°; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid; 15 N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid; 20 N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid; 25 N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-30 ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid; N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-

ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

5

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperazino-acetamid;

10

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid;

15

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid;

20

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid;

30

25

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

35

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-2-piperazino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(6-(3-lsopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-lsopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-lsopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-2-piperazino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-morpholinyl)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diethylamino)-acetamid;

10

5

15

20

30

25

10

15

20

25

30

35

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(N,N-diisopropylamino)acetamid; N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-thiomorpholino-acetamid; N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-piperidino-acetamid; N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-hydroxy-piperidino)-acetamid; N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-2-piperazino-acetamid; N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-pyrrolidino-acetamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyll-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäure amid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propion-säureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-

pyridazin-2-ylmethyl)-phenyll-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid; 5 N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäure amid; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid; 10 N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propion-säureamid; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Propoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-15 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-20 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-25 pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid; 30 N-[4-(6-(3-Isopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid; N-[4-(6-(3-lsopropoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäureamid; 35 N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetra-

hydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-morpholinyl)-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diethylamino)propionsäureamid;

5

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(N,N-diisopropylamino)-propionsäureamid:

10

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-thiomorpholino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperidino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-(4-hydroxy-piperidino)-propionsäureamid:

15

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-piperazino-propionsäureamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-3-pyrrolidino-propionsäure-amid;

20

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

25

und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose, Diabetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.

30

Gegenstand der Erfindung ist insbesondere die Verwendung von

a) Verbindungen, offenbart in EP 0 738 715 A2, ausgewählt aus der Gruppe

2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on;

35

2-(3-Methylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on;

20

- 2-(3-Acetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-tetrahydropyridazin-3-on;
- 2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
- 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on;
  - b) Verbindungen, offenbart in EP 0 723 962 B1, ausgewählt aus der Gruppe
- 3-(4-Nitrobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Aminobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Trifluoroacetamidobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Acetamidobenzyl)-5-(3,4-dimethoxy-phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Methoxybenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-one;
  - 3-(2,6-Dichlorobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - c) Verbindungen, offenbart in EP 0 763 534 A1, ausgewählt aus der Gruppe
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
  - 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 35 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;

- 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on;
- 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on;
- 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5tetrahydro-pyridazin-3-on;
- Verbindungen, offenbart in EP 0 539 806 B1, ausgewählt aus der Gruppe
- 10 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on;

20

25

30

- 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2on;
- e) Verbindungen, offenbart in EP 0 618 201 A1, ausgewählt aus der 15 Gruppe
  - 3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
  - 3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazinon-2-on;
    - 3-Dimethylaminoethyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
    - 3-Piperidinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
    - 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on;
    - f) Verbindungen, offenbart in DE 196 04 388 A1, ausgewählt aus der Gruppe
    - N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;
    - N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)propylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethyl-amino)-propylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methylpiperazino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methylpiperazino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(4-methyl-piperazino)-acetamid;

und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose, Diabetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.

25

20

5

. 10

15

### Patentansprüche

#### 1. Verwendung von

a) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 738 715 A2,

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander -OH, -OR<sup>10</sup>, -S-R<sup>10</sup>,

-SO-R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>10</sup>, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHR<sup>10</sup> oder -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>.

20 einen unsubstituierten oder ein- oder zweifach durch R<sup>6</sup> und/oder R<sup>7</sup> substituierten Phenylrest,

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander -NH<sub>2</sub>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -NHR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -NO<sub>2</sub>, Hal, -CN, -OA, -COOH oder -COOA,

R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> jeweils unabhängig voneinander H, Acyl mit 1-8 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substituiert sein kann, -COOA, -SO-A, -SO<sub>2</sub>A,

-CONH<sub>2</sub>, -CONHA, -CONA<sub>2</sub>, -CO-COOH, -CO-COOA, -CO-CONH<sub>2</sub>, -CO-CONHA oder -CO-CONA<sub>2</sub>,

A Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substituiert sein kann,

30

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder Alkenyl mit 2-8 C-Atomen

und

Hal

F, CI, Br oder I

bedeuten,

b) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 723 962 B1,

10

15

20

5

$$R^{4} \longrightarrow R^{1} \longrightarrow R^{2}$$

$$N-N$$

$$Q-R^{5}$$

worin

\_1

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander -OH, -OR<sup>10</sup>, -S-R<sup>10</sup>,

-SO-R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>10</sup>, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHR<sup>10</sup> oder -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>,

R<sup>5</sup> einen unsubstituierten oder ein- oder zweifach durch R<sup>6</sup>

25 und/oder R<sup>7</sup> substituierten Phenylrest,

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander -NH<sub>2</sub>, -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, -NHR<sup>10</sup>,

-NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>, -NO<sub>2</sub>, Hal, -CN, -OA, -COOH oder -COOA,

30 R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> jeweils unabhängig voneinander H, Acyl mit 1-8 C-

Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substitu-

iert sein kann, -COOA, -SO-A, -SO<sub>2</sub>A,

-CONH<sub>2</sub>, -CONHA, -CONA<sub>2</sub>, -CO-COOH, -CO-COOA,

-CO-CONH2, -CO-CONHA oder -CO-CONA2,

10

25

35

A Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, das durch 1-5 F- und/oder Cl-Atome substituiert sein kann,

R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder

Alkenyl mit 2-8 C-Atomen

und

Hal F, Cl, Br oder I

bedeuten,

c) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 763 534 A1,

worin

einen aromatischen Heterocyclus mit 1 bis 4 N-, Ound/oder S-Atomen, über N oder C gebunden, der unsubstituiert oder ein-, zwei- oder dreifach durch Hal, A
und/oder OA substituiert sein kann, und auch an einen
Benzol- oder Pyridinring kondensiert sein kann,

Q fehlt oder Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

30 X  $CH_2$ , S oder O,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander -OH, OR<sup>5</sup>, -S-R<sup>5</sup>, -SO-R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>5</sup>, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

-NHR<sup>5</sup> oder -NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>,

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> jeweils unabhängig voneinander A, Cycloalkyl mit 3-7

25

30

C-Atomen, Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen oder Alkenyl mit 2-8 C-Atomen,

A Alkyl mit 1 bis 10 C-Atomen, das durch 1 bis 5 Fund/oder Cl-Atome substituiert sein kann und

Hal F, Cl, Br oder I bedeuten,

d) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 539 806 B1,

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

20  $R^3$  H, OA oder O-C<sub>m</sub>H<sub>2m+1-n</sub>X<sub>n</sub>,

 $R^4$  -O-C<sub>m</sub>H<sub>2m+1-n</sub>X<sub>n</sub>,

X F oder CI,

A Alkyl mit 1-6 C-Atomen,

m 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 und

n 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12 oder 13 bedeuten,

e) Verbindungen der Formel I, offenbart in EP 0 618 201 A1,

 $\begin{array}{c|c}
R^3 & R^2 \\
\hline
 & N-N \\
\hline
 & Q-R^5
\end{array}$ 

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> jeweils unabhängig voneinander OH, OA, SA, SOA,

SO<sub>2</sub>A, Hal, Methylendioxy, Cycloalkyloxy mit 3-7 C-

Atomen oder O- $C_mH_{2m+1-k}F_k$ ,

 $R^5$  -NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> oder -N (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>,

10 wobei eine CH<sub>2</sub>-Gruppe auch durch Sauerstoff ersetzt

sein kann,

R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

Q Alkylen mit 1-6 C-Atomen,

15 A Alkyl mit 1-6 C-Atomen,

Hal F, Cl, Br oder I,

m 1, 2, 3, 4, 5 oder 6,

n 3, 4, 5 oder 6,

20 k 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12 oder 13

bedeuten,

f) Verbindungen der Formel I, offenbart in DE 196 04 388 A1,

25

30

5

$$R^3$$
 $R^4$ 
 $N-N$ 
 $Q$ 
 $NH-CO-B$ 

worin

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> jeweils unabhängig voneinander H oder A,

35 R³ und R⁴ jeweils unabhängig voneinander -OH, OA, -S-A,

-SO-A, -SO<sub>2</sub>-A, Hal, Methylendioxy, -NO<sub>2</sub>, -NH<sub>2</sub>,

		A und A'	-NHA oder -NAA', jeweils unabhängig voneinander Alkyl mit 1 bis 10 C- Atomen, das durch 1 bis 5 F- und/oder Cl-Atome substi-
5 .			tuiert sein kann, Cycloalkyl mit 3-7 C-Atomen oder Methylencycloalkyl mit 4-8 C-Atomen,
		В	-Y-R <sup>5</sup> oder -O-Y-R <sup>5</sup> ,
		Q	fehlt oder Alkylen mit 1-4 C-Atomen,
10		Y	fehlt oder Alkylen mit 1-10 C-Atomen,
10		X 55	CH₂ oder S,
		R <sup>5</sup>	NH <sub>2</sub> , NHA, NAA' oder einen unsubstituierten oder ein-
			fach durch A oder OH substituierten gesättigten 3-8-
			gliedrigen Heterocyclus mit mindestens einem N-Atom,
15			worin zusätzlich weitere CH <sub>2</sub> -Gruppen durch NH, NA, S
			oder O ersetzt sein können,
		Hal	F, CI, Br oder I
		bedeuten,	·
20			er physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung mittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren,
		Tumormetas	tasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple
		Sklerose, Dia	abetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.
25			
	2.	Verwendung	nach Anspruch 1 von
	a)	Verbindunge	n, offenbart in EP 0 738 715 A2, ausgewählt aus der
30		Gruppe	
		2-(4-Eth	noxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-
		2,3,4,5-tetral	nydro-pyridazin-3-on;
		2-(3-Me	thylsulfonamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
25		tetrahydro-py	vridazin-3-on;
35		2-(3-Ac	etamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-2,3,4,5-
		tetrahydro-py	vridazin-3-on;

2-(4-Trifluoracetamidobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Ethoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 5 2-(4-Methoxycarbonylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on; 2-(4-Butyrylaminobenzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 10 b) Verbindungen, offenbart in EP 0 723 962 B1, ausgewählt aus der Gruppe 3-(4-Nitrobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Aminobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-15 1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Trifluoroacetamidobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Acetamidobenzyl)-5-(3,4-dimethoxy-phenyl)-3,6-dihydro-20 1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Methoxybenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-one; 3-(2,6-Dichlorobenzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-25 dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; Verbindungen, offenbart in EP 0 763 534 A1, ausgewählt aus der C) Gruppe 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 30 3-(4-Picolinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 35 3-(4-Isonicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on:

3-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-oxadiazin-2-on; 2-(4-Nicotinoylamino-benzyl)-6-(3,4-dimethoxyphenyl)-5-ethyl-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-3-on: 5 d) Verbindungen, offenbart in EP 0 539 806 B1, ausgewählt aus der Gruppe 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazin-2-on; 10 5-(3-Methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-3,6-dihydro-1,3,4thiadiazin-2-on; Verbindungen, offenbart in EP 0 618 201 A1, ausgewählt aus der e) Gruppe 3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-15 dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Dimethylaminopropyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Dimethylaminoethyl-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-6-ethyl-3,6-20 dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Piperidinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; 3-Morpholinopropyl-5-(3-methoxy-4-difluormethoxy-phenyl)-6-25 ethyl-3,6-dihydro-1,3,4-thiadiazinon-2-on; Verbindungen, offenbart in DE 196 04 388 A1, ausgewählt aus der f) Gruppe N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3,4-dimethoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-30 propylester; N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

N-[4-(6-(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethyl-amino)-propylester;

5

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-3-(N,N-diethylamino)-propylester;

10

N-[4-(6-(3-Ethoxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetrahydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methylpiperazino)-acetamid;

N-[4-(6-(3-Cyclopentyloxy-4-methoxyphenyl)-3-oxo-2,3,4,5-tetra-hydro-pyridazin-2-ylmethyl)-phenyl]-2-(4-methylpiperazino)-acetamid;

N-[4-(3,6-Dihydro-5-(3-ethoxy-4-methoxyphenyl)-2-oxo-2H-1,3,4-thiadiazin-3-ylmethyl)-phenyl]-carbaminsäure-2-(4-methyl-piperazino)-acetamid;

15

und/oder ihrer physiologisch unbedenklichen Salze zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung von Osteoporose, Tumoren, Tumormetastasen, Atherosklerose, rheumatoide Arthritis, multiple Sklerose, Diabetes mellitus, ulzerative Kolitis und AIDS.

20

 Verwendung nach Anspruch 1 oder 2 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung neoplastischer Schädigungen.

- 4. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Behandlung präcancerogener Schädigungen.
- 5. Verwendung nach Anspruch 1 oder 2 zur Herstellung eines Arzneimittels zur Regulierung von Apoptose in menschlichen Zellen.



A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 A61K31/50 A61K31/54 A61P37/00 A61P3/10

A61K31/535 A6

A61P19/10

A61P35/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

#### B. FIELDS SEARCHED

 $\begin{array}{ll} \mbox{MinImum documentation searched (classification system followed by classification symbols)} \\ \mbox{IPC 7} & \mbox{A61K} & \mbox{A61P} \end{array}$ 

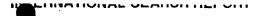
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to daim No.	
Y	EP 0 738 715 A (MERCK PATENT GMBH) 23 October 1996 (1996-10-23) cited in the application page 2, line 1-57 page 7, line 22-26; claims 7-10	1-5	
Y	EP 0 723 962 A (MERCK PATENT GMBH) 31 July 1996 (1996-07-31) cited in the application page 2, line 1-52 page 6, line 11-13; claims 7,8	1-5	
Y	EP 0 763 534 A (MERCK PATENT GMBH)  19 March 1997 (1997-03-19)  cited in the application  page 2, line 1-54  page 6, line 57 -page 7, line 2; claims  7-10	1-5	

X Further documents are listed in the continuation of box C.	Patent family members are listed in annex.
* Special categories of cited documents:  *A' document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  *E' earlier document but published on or after the international filling date  *L' document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  *O' document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means  *P' document published prior to the international filling date but later than the priority date claimed	<ul> <li>'T' later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</li> <li>'X' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</li> <li>'Y' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</li> <li>'&amp;' document member of the same patent family</li> </ul>
Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
9 January 2003	20/01/2003
Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Friederich, M





	.1/EP 02/1050/
Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
EP 0 539 806 A (MERCK PATENT GMBH) 5 May 1993 (1993-05-05) cited in the application page 2, line 1-41; claims 6,7 page 4, line 53-55	1-5
EP 0 618 201 A (MERCK PATENT GMBH) 5 October 1994 (1994-10-05) cited in the application page 2, line 1-57 page 6, line 41-43; claims 7,8	1-5
DE 196 04 388 A (MERCK PATENT GMBH) 14 August 1997 (1997-08-14) cited in the application page 2, line 1-48 page 6, line 66 -page 7, line 2; claims 7-10	1-5
DYKE H J ET AL: "THE THERAPEUTIC POTENTIAL OF PDE4 INHIBITORS" EXPERT OPINION ON INVESTIGATIONAL DRUGS, ASHLEY PUBLICATIONS LTD., LONDON, GB, vol. 8, no. 9, 1999, pages 1301-1325, XP001096074 ISSN: 1354-3784 * Kapitel 2-10 *	1-5
EP 0 779 291 A (BAYER AG) 18 June 1997 (1997-06-18) cited in the application page 8, line 33-52	1-5
WO 95 35281 A (CELLTECH THERAPEUTICS LTD) 28 December 1995 (1995-12-28) cited in the application page 19, line 34 -page 21, line 11	1-5
	Citation of document. with indication, where appropriate, of the relevant passages  EP 0 539 806 A (MERCK PATENT GMBH) 5 May 1993 (1993-05-05) cited in the application page 2, line 1-41; claims 6,7 page 4, line 53-55  EP 0 618 201 A (MERCK PATENT GMBH) 5 October 1994 (1994-10-05) cited in the application page 2, line 1-57 page 6, line 41-43; claims 7,8  ——  DE 196 04 388 A (MERCK PATENT GMBH) 14 August 1997 (1997-08-14) cited in the application page 2, line 1-48 page 6, line 66 -page 7, line 2; claims 7-10  DYKE H J ET AL: "THE THERAPEUTIC POTENTIAL OF PDE4 INHIBITORS" EXPERT OPINION ON INVESTIGATIONAL DRUGS, ASHLEY PUBLICATIONS LTD., LONDON, GB, vol. 8, no. 9, 1999, pages 1301-1325, XP001096074 ISSN: 1354-3784 * Kapitel 2-10 *  EP 0 779 291 A (BAYER AG) 18 June 1997 (1997-06-18) cited in the application page 8, line 33-52  WO 95 35281 A (CELLTECH THERAPEUTICS LTD) 28 December 1995 (1995-12-28) cited in the application

## International Seanon ner one Information on patent family members

			TCI/Er	02/1050/
Patent document cited in search report	Publication date	,	Patent family member(s)	Publication date
EP 0738715 A	23-10-1996	DE AU CA CN CZ EP HU JP NO RU SK TW US US ZA	19514568 A1 705025 B2 5071196 A 2174472 A1 1142493 A 9601132 A3 0738715 A2 9601034 A2 8291145 A 961578 A 2159236 C2 48796 A3 475927 B 2002111356 A1 6399611 B1 9603154 A	24-10-1996 13-05-1999 31-10-1996 21-10-1996 12-02-1997 13-11-1996 23-10-1996 30-12-1996 05-11-1996 21-10-1996 20-11-2000 05-02-1997 11-02-2002 15-08-2002 04-06-2002 06-12-1996
EP 0723962 A	31-07-1996	DE AU AU CZ DE DK EP SR HU PTU SK US ZA	19502699 A1 202775 T 705639 B2 4211196 A 2168193 A1 9600251 A3 59607188 D1 723962 T3 0723962 A1 2160184 T3 3036343 T3 73981 A2 8231522 A 960352 A 312489 A1 723962 T 2161613 C2 723962 T1 12396 A3 6025354 A 5747489 A 9600630 A	01-08-1996 15-07-2001 27-05-1999 08-08-1996 29-07-1996 14-08-1996 09-08-2001 29-10-2001 31-07-1996 01-11-2001 30-11-2001 28-10-1996 10-09-1996 29-07-1996 05-08-1996 31-10-2001 10-01-2001 31-12-2001 01-10-1996 15-02-2000 05-05-1998 15-08-1996
EP 0763534 A	19-03-1997	DE AU BR CA CZ EP HU JP NO PL RU SK US ZA	19533975 A1 716113 B2 6551796 A 9603736 A 2185397 A1 1157287 A 9602630 A3 0763534 A1 9602511 A2 9124611 A 963852 A 316070 A1 2167159 C2 110096 A3 5859008 A 9607766 A	20-03-1997 17-02-2000 20-03-1997 26-05-1998 15-03-1997 20-08-1997 18-03-1997 28-03-1997 13-05-1997 17-03-1997 17-03-1997 20-05-2001 06-08-1997 12-01-1999 26-03-1997
EP 0539806 A	05-05-1993	DE	4134893 A1	29-04-1993

						101/11	02/1030/
	t document search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
EP. 05	539806			AT AU CA CZ DE DK EP ES HU JP JP MX NO PL US ZA	11664 65344 272319 208104 920263 5920114 53980 053980 206654 6793 319378 522201 920604 92409 29631 527602 920823	4 B2 2 A 9 A1 66 A3 8 D1 16 A1 10 T3 8 A2 8 B2 7 A 12 A1 18 A 14 A2 27 A	15-01-1995 29-09-1994 29-04-1993 24-04-1993 12-05-1993 16-02-1995 13-03-1995 05-05-1993 01-03-1995 29-05-1995 30-07-2001 31-08-1993 01-04-1993 26-04-1993 04-05-1993 04-01-1994 06-05-1993
EP O	618201	A	 05-10-1994	DE AU CA CN CZ EP HU JP NO SK US	700281 94119	88 B2 94 A 91 A1 94 A 95 A3 91 A1 93 A2 12 A 94 A3	06-10-1994 06-02-1997 06-10-1994 02-10-1994 19-04-1995 15-12-1994 05-10-1994 30-10-1995 06-01-1995 03-10-1994 07-12-1994 18-07-1995
DE 1	9604388	A	14-08-1997	DE	1960438	38 A1	14-08-1997
EP 0	779291	Α	18-06-1997	AT CA DE DK EP ES JP PT US	20676 219228 6961586 6961586 77929 077929 21619 92027 77929 59227	31 A1 02 D1 02 T2 91 T3 91 A1 55 T3 85 A	15-10-2001 12-06-1997 15-11-2001 04-04-2002 21-01-2002 18-06-1997 16-12-2001 05-08-1997 28-02-2002 13-07-1999
WO 9	535281	Α .	28-12-1995	AU CA CN CZ EP FI WO GB HU JP NO NZ SK	27461 21926 11517 96037 07700 9651 95352 23026 768 105031 9655 2882	43 A1 32 A 30 A3 65 A1 26 A 81 A1 92 A , B 03 A2 73 T 24 A	08-07-1999 15-01-1996 28-12-1995 11-06-1997 13-08-1997 02-05-1997 19-12-1996 28-12-1995 29-01-1997 28-11-1997 24-03-1998 20-12-1996 28-01-1999 08-10-1997



Intertional Application No PCT/EP 02/10507

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
WO 9535281	A		US	6077854 A	20-06-2000
			US	5786354 A	28-07-1998

klassifizierung des anmeldungsgegenstandes PK 7 A61K31/50 A61K31/54

A61K31/535 A61P3/10

A61P19/10

A61P35/00

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

#### B. RECHERCHIERTE GEBIETE

IN I EDINATION

A61P37/00

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole )

A61K A61P IPK 7

Recherchiene aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchienen Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLI	CH ANGESEHENE UNTERLAGEN
-----------------	--------------------------

Kalegorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erfordertich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 738 715 A (MERCK PATENT GMBH) 23. Oktober 1996 (1996-10-23) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-57 Seite 7, Zeile 22-26; Ansprüche 7-10	1-5
Y	EP 0 723 962 A (MERCK PATENT GMBH) 31. Juli 1996 (1996-07-31) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-52 Seite 6, Zeile 11-13; Ansprüche 7,8	1-5
Y	EP 0 763 534 A (MERCK PATENT GMBH) 19. März 1997 (1997-03-19) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-54 Seite 6, Zeile 57 -Seite 7, Zeile 2; Ansprüche 7-10	1-5
	-/	

١	Y	Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
1		entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie
- ausgeführt)
  Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,
  eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
  Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach
  dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- 'T' Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundellegenden Prinzips oder der ihr zugrundellegenden Theorie angegeben ist
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erlindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

#### 9. Januar 2003

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2

NL - 2280 HV Rijswljk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016

20/01/2003 Bevollmächtigter Bediensteter

Friederich, M

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intertionales Aktenzeichen
PCT/EP 02/10507

	•	PCT/EP 0	2/10507
C.(Fortsetz	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	<u> </u>	<del></del>
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, sowelt erforderlich unter Angabe der in Betracht komm	enden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Υ	EP 0 539 806 A (MERCK PATENT GMBH) 5. Mai 1993 (1993-05-05) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-41; Ansprüche 6,7 Seite 4, Zeile 53-55		1-5
Y	EP 0 618 201 A (MERCK PATENT GMBH) 5. Oktober 1994 (1994-10-05) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-57 Seite 6, Zeile 41-43; Ansprüche 7,8		1-5
Υ	DE 196 04 388 A (MERCK PATENT GMBH) 14. August 1997 (1997-08-14) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 1-48 Seite 6, Zeile 66 -Seite 7, Zeile 2; Ansprüche 7-10		1-5
Y	DYKE H J ET AL: "THE THERAPEUTIC POTENTIAL OF PDE4 INHIBITORS" EXPERT OPINION ON INVESTIGATIONAL DRUGS, ASHLEY PUBLICATIONS LTD., LONDON, GB, Bd. 8, Nr. 9, 1999, Seiten 1301-1325, XP001096074 ISSN: 1354-3784 * Kapitel 2-10 *		1-5
Y	EP 0 779 291 A (BAYER AG) 18. Juni 1997 (1997-06-18) in der Anmeldung erwähnt Seite 8, Zeile 33-52		1-5
Y	WO 95 35281 A (CELLTECH THERAPEUTICS LTD) 28. Dezember 1995 (1995-12-28) in der Anmeldung erwähnt Seite 19, Zeile 34 -Seite 21, Zeile 11		1-5
			·

# Angaben zu Veröffentlichtungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interionales Aktenzeichen PCT/EP 02/10507

im Recherchenber		Datum der		Mitglied(er) der	Datum der
angeführtes Patentdo	kument	Veröffentlichung		Patentfamille	Veröffentlichung
EP 0738715	Α	23-10-1996	DE	19514568 A1	24-10-1996
			AU	705025 B2	13-05-1999
			AU	5071196 A	31-10-1996
			CA	2174472 A1	21-10-1996
			CN	1142493 A	12-02-1997
			CZ	9601132 A3	13-11-1996
			EP	0738715 A2	23-10-1996
			JP	9601034 A2 8291145 A	30-12-1996 05-11-1996
			NO	961578 A	21-10-1996
			RU	2159236 C2	20-11-2000
			SK	48796 A3	05-02-1997
			TW	475927 B	11-02-2002
			ÜS	2002111356 A1	15-08-2002
			US	6399611 B1	04-06-2002
			ZA	9603154 A	06-12-1996
EP 0723962	A	31-07-1996	DE	19502699 A1	01-08-1996
EI 0/23902	М	21-01-1330	AT	202775 T	15-07-2001
			AU	705639 B2	27-05-1999
			AU	4211196 A	08-08-1996
			CA	2168193 A1	29-07-1996
			CZ	9600251 A3	14-08-1996
			DE	59607188 D1	09-08-2001
			DK	723962 T3	29-10-2001
			EΡ	0723962 A1	31-07-1996
			ES	2160184 T3	01-11-2001
			GR	3036343 T3	30-11-2001
			HU	73981 A2	28-10-1996
			JP	8231522 A	10-09-1996
			NO	960352 A	29-07-1996
			PL	312489 A1	05-08-1996 31-10-2001
			PT RU	723962 T 2161613 C2	10-01-2001
			SI	723962 T1	31-12-2001
			SK	12396 A3	01-10-1996
			US	6025354 A	15-02-2000
			ÜS	5747489 A	05-05-1998
			ZA	9600630 A	15-08-1996
EP 0763534	Α	 19-03-1997	DE	19533975 A1	20-03-1997
ET 0/03534	, м	13-03-133/	AU	716113 B2	17-02-2000
			AU	6551796 A	20-03-1997
			BR	9603736 A	26-05-1998
			CA	2185397 A1	15-03-1997
			CN	1157287 A	20-08-1997
			CZ	9602630 A3	18-03-1998
			EP	0763534 A1	19-03-1997
			HU	9602511 A2	28-03-1997
			JP	9124611 A	13-05-1997
			NO	963852 A	17-03-1997
			PL	316070 A1	17-03-1997
			RU	2167159 C2	20-05-2001
			SK	110096 A3	06-08-1997
			US	5859008 A	12-01-1999
			ZA	9607766 A	26-03-1997

INTERNATIONALER RECRENCHENBERICHT
Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentlamilie gehören

Intalionates Aktenzeichen PCT/EP 02/10507

Angaben za Veronenmenangen		PCT/EP 02/10507			
lm Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
EP 0539806 #		AT AU CA CZ DE DK EP ES HU JP JP MX NO PL US ZA	116644 T 653444 B2 2723192 A 2081049 A1 9202636 A3 59201148 D1 539806 T3 0539806 A1 2066540 T3 67938 A2 3193789 B2 5222017 A 9206042 A1 924098 A 296314 A2 5276027 A 9208236 A	15-01-1995 29-09-1994 29-04-1993 24-04-1993 12-05-1993 16-02-1995 13-03-1995 05-05-1993 01-03-1995 29-05-1995 30-07-2001 31-08-1993 01-04-1993 04-01-1994 06-05-1993	
EP 0618201	05-10-1994	DE AU CA CN CZ EP HU JP NO SK US	4310699 A1 675488 B2 5798394 A 2120301 A1 1101644 A 9400705 A3 0618201 A1 70543 A2 7002812 A 941150 A 38594 A3 5434149 A	06-10-1994 06-02-1997 06-10-1994 02-10-1994 19-04-1995 15-12-1994 05-10-1994 30-10-1995 06-01-1995 03-10-1994 07-12-1994 18-07-1995	
DE 19604388	A 14-08-1997	DE	19604388 A1	14-08-1997	
EP 0779291	A 18-06-1997	AT CA DE DK EP ES JP PT US	206709 T 2192281 A1 69615802 D1 69615802 T2 779291 T3 0779291 A1 2161955 T3 9202785 A 779291 T 5922740 A	15-10-2001 12-06-1997 15-11-2001 04-04-2002 21-01-2002 18-06-1997 16-12-2001 05-08-1997 28-02-2002 13-07-1999	
WO 9535281	A 28-12-1995	AU CA CN CZ EP FI WO GB HU JP NO NZ SK	707472 B2 2746195 A 2192643 A1 1151732 A 9603730 A3 0770065 A1 965126 A 9535281 A1 2302692 A ,B 76803 A2 10503173 T 965524 A 288294 A 163096 A3	08-07-1999 15-01-1996 28-12-1995 11-06-1997 13-08-1997 02-05-1997 19-12-1996 28-12-1995 29-01-1997 28-11-1997 24-03-1998 20-12-1996 28-01-1999 08-10-1997	

TENNATIONA TO RECITE TO HEADED OF

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interionales Aktenzeichen
PCT/EP 02/10507

lm Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 9535281 A		US	6077854 A	20-06-2000
		US 	5786354 A	28-07-1998

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentiamilie)(Juli 1992)